

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES  
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro



03 JUN 2005

(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
24. Juni 2004 (24.06.2004)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
WO 2004/052852 A1 not sk

(51) Internationale Patentklassifikation?: C07D 207/34,  
A61K 31/40, 31/402, 31/4025, C07D 401/06, 401/12,  
403/06, 403/12, 405/12, 413/06, 405/06

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von  
US): BAYER HEALTHCARE AG [DE/DE]; 51368 Lev-  
erkusen (DE).

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2003/013278

(72) Erfinder; und

(22) Internationales Anmeldedatum:  
26. November 2003 (26.11.2003)

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): ZIMMERMANN,  
Holger [DE/DE]; Katernberger Schulweg 53, 42113  
Wuppertal (DE). BRÜCKNER, David [DE/DE]; Fis-  
cherstr. 15, 45128 Essen (DE). HEIMBACH, Dirk  
[DE/DE]; An der Kaiserburg 13, 40629 Düsseldorf  
(DE). HENNINGER, Kerstin [DE/DE]; Claudiusweg  
7, 42115 Wuppertal (DE). HEWLETT, Guy [GB/DE];  
Krutscheider Weg 96, 42327 Wuppertal (DE). ROSEN-  
TRETER, Ulrich [DE/DE]; Obere Rutenbeck 6, 42349  
Wuppertal (DE). SCHOHE-LOOP, Rudolf [DE/DE];  
Arndtstr. 10 a, 42327 Wuppertal (DE). BAUMEISTER,

(25) Einreichungssprache: Deutsch

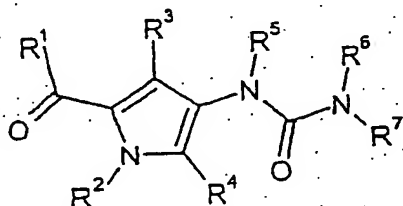
(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:  
102 57 358.1 9. Dezember 2002 (09.12.2002) DE

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: 3-PYRROLYL UREA DERIVATIVES AND THEIR USE AS ANTIVIRAL AGENTS

(54) Bezeichnung: 3-PYRROLYL-HARNSTOFF-DERIVATE UND IHRE VERWENDUNG ALS ANTIVIRALE MITTEL



(I)

(57) **Abstract:** The invention relates to substituted pyrroles of formula (I), in which: R<sup>1</sup> represents -OR<sup>8</sup> or -NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>; R<sup>2</sup> represents hydrogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkyl or aryl, whereby R<sup>2</sup> as an alkyl can be substituted with 0, 1, 2 or 3 substituents R<sup>2-1</sup> independently of one another, selected from the group comprising halogen, hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkoxy, hydroxycarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkoxycarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkylcarbonyloxy, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkylamino, aminocarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkylaminocarbonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> cycloalkyl, a 5- to 10-membered heterocyclyl, C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> aryl, phenoxy

and a 5- to 10-membered heteroaryl and whereby R<sup>2</sup> as an aryl can be substituted with 0, 1, 2 or 3 substituents R<sup>2-2</sup> independently of one another, selected from the group comprising halogen, hydroxy, nitro, cyano, trifluoromethyl, trifluoromethoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkoxy, hydroxycarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkoxycarbonyl, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkylamino, aminocarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkylaminocarbonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> cycloalkyl, a 5- to 10-membered heterocyclyl, C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> aryl and a 5- to 10-membered heteroaryl; R<sup>3</sup> and R<sup>4</sup> independently of one another represent hydrogen or C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkyl; R<sup>5</sup> and R<sup>6</sup> independently of one another represent hydrogen or C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkyl; and R<sup>7</sup> represents a 3- to 12-membered carbocyclyl, whereby the carbocyclyl can be substituted with 0, 1, 2, 3, 4 or 5 substituents independently of one another, selected from the group comprising halogen, hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkyl and C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkoxy. The invention also relates to a method for producing said pyrroles, to their use for the treatment and/or prophylaxis of diseases, in addition to their use for producing medicaments for the treatment and/or prophylaxis of diseases, notably to their use as antiviral agents, in particular against cytomegaloviruses.

(57) **Zusammenfassung:** Die Erfindung betrifft substituierte Pyrrole der Formel (I), in welcher R<sup>1</sup> für -OR<sup>8</sup> oder -NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup> steht, R<sup>2</sup> für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl oder Aryl steht, wobei R<sup>2</sup> gleich Alkyl substituiert sein kann mit 0, 1, 2 oder 3 Substituenten R<sup>2-1</sup> unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Halogen, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, Hydroxycarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxycarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyloxy, Amino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino, Aminocarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylaminocarbonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl, 5- bis 10-gliedriges Heterocyclyl, C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-Aryl, Phenoxy und 5- bis 10-gliedriges Heteroaryl, wobei R<sup>2</sup> gleich Aryl substituiert sein kann mit 0, 1, 2 oder 3 Substituenten R<sup>2-2</sup> unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Halogen, Hydroxy, Nitro, Cyano, Trifluormethoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, Hydroxycarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxycarbonyl, Amino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylaminocarbonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl, 5- bis 10-gliedriges Heterocyclyl, C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-Aryl und 5- bis 10-gliedriges Heteroaryl, R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> unabhängig voneinander für Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl stehen, R<sup>5</sup> und R<sup>6</sup> unabhängig voneinander für Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl stehen, R<sup>7</sup> für 3- bis 12-gliedriges Carbocyclyl steht, wobei das Carbocyclyl substituiert sein kann mit 0, 1, 2, 3, 4 oder 5 Substituenten unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Halogen, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl und C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, und Verfahren zu ihrer Herstellung, ihre Verwendung zur Behandlung und/oder Prophylaxe von Krankheiten sowie ihre Verwendung zur Herstellung von Arzneimitteln zur Behandlung und/oder Prophylaxe von Krankheiten, insbesondere zur Verwendung als antivirale Mittel, insbesondere gegen Cytomegaloviren.

WO 2004/052852 A1

36 492



Judith [DE/DE]; Kreuzstr. 46, 42277 Wuppertal (DE). SCHMIDT, Thorsten [DE/DE]; Gartenstr. 187, 60596 Frankfurt (DE). REEFSCHLÄGER, Jürgen [DE/DE]; Nedderlandsweg 45, 26125 Oldenburg (DE). LANG, Dieter [DE/DE]; Wimmersbergerstr. 60, 42553 Velbert (DE). LIN, Tse-I. [CN/DE]; Elisabethstr. 5, 42287 Wuppertal (DE). RADTKE, Martin [DE/DE]; Am Mergelsberg 36, 40699 Erkrath (DE).

(74) Gemeinsamer Vertreter: BAYER HEALTHCARE AG; Law and Patents, Patents and Licensing, 51368 Leverkusen (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (*national*): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (*regional*): ARIPO-Patent (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

#### Veröffentlicht:

- mit internationalem Recherchenbericht
- vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen eintreffen

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.